

XP-002402382

AN - 1982:563007 CAPLUS
 DN - 97:163007
 TI - 2-Chloro-3,4-dihydrothieno[2,3-d]pyrimidines
 PA - Daiichi Seiyaku Co., Ltd., Japan
 SO - Jpn. Kokai Tokyo Koho, 2 pp.
 CODEN: JKXXAF

DT - Patent
 LA - Japanese

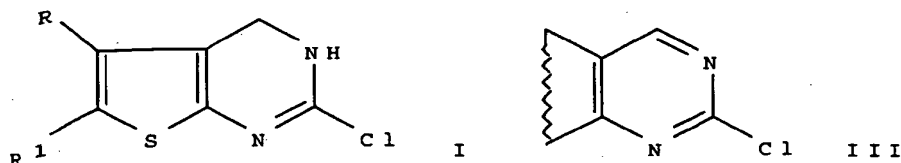
FAN.CNT 1

PATENT NO.	KIND	DATE	APPLICATION NO.	DATE
PN - JP57077687	A2	19820515	JP 1980-154949	19801104

PRAI- JP 1980-154949

19801104

GI



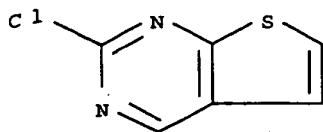
AB The title compds. I [R = H, CH:CHCH:CH (II), halo, alkyl], useful as inhibitors for blood platelet aggregation (no data), were prepd. by alkali metal borohydride redn. of III. Thus, treatment of 2.25 g III (R = CH:CHCH:CH) in CHCl₃-EtOH (1:1) with 2.00 g NaBH₄ at room temp. for 8 h gave 1.85 g II.

IT ***83259-30-7*** ***83259-31-8*** ***83259-32-9***
 83259-33-0

RL: RCT (Reactant); RACT (Reactant or reagent)
 (hydride redn. of)

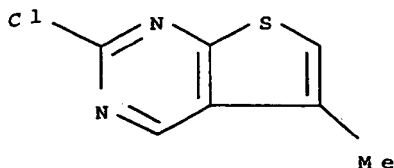
RN 83259-30-7 CAPLUS

CN Thieno[2,3-d]pyrimidine, 2-chloro- (9CI) (CA INDEX NAME)



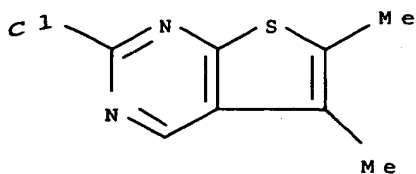
RN 83259-31-8 CAPLUS

CN Thieno[2,3-d]pyrimidine, 2-chloro-5-methyl- (9CI) (CA INDEX NAME)



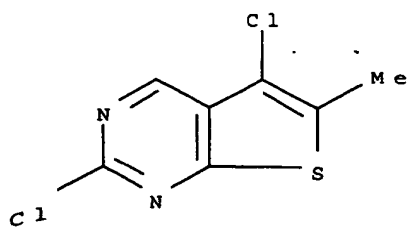
83259-32-9 CAPLUS

RN
CN Thieno[2,3-d]pyrimidine, 2-chloro-5,6-dimethyl- (9CI) (CA INDEX
NAME)



83259-33-0 CAPLUS

RN
CN Thieno[2,3-d]pyrimidine, 2,5-dichloro-6-methyl- (9CI) (CA INDEX
NAME)



?

⑫ 公開特許公報 (A)

昭57-77687-

⑤ Int. Cl.³
C 07 D 495/04識別記号
1 0 5庁内整理番号
7252-4C

④ 公開 昭和57年(1982)5月15日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 2 頁)

⑤ 2-クロロ-3,4-ジヒドロチエノ [2,3-d] ピリミジン類化合物の新規製造法

① 特 願 昭55-154949

② 出 願 昭55(1980)11月4日

特許法第30条第1項適用 昭和55年10月18日
発行第13回複素環化学討論会講演要旨集に発表

⑦ 発 明 者 石川文義

東京都江戸川区北葛西一丁目16
番13号第一製薬研究所内

⑦ 発 明 者 山口等

東京都江戸川区北葛西一丁目16
番13号第一製薬研究所内

⑦ 出 願 人 第一製薬株式会社

東京都中央区日本橋3丁目14番
10号

⑦ 代 理 人 内丸文彦

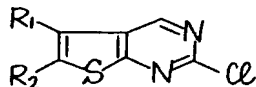
明 細 書

1. 発明の名称

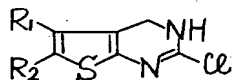
2-クロロ-3,4-ジヒドロチエノ [2,3-d] ピリミジン類化合物の新規製造法

2. 特許請求の範囲

式

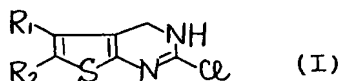


で示される化合物を水素化ホウ素アルカリ金属類と反応させることを特徴とする式

で示される化合物の製造法。ただし、R₁、R₂は、それぞれ水素、アルキル、ハロゲンもしくは一筋になってアルキレン鎖又は異種原子を含むアルキレン鎖を意味する。

3. 発明の詳細な説明

本発明は式



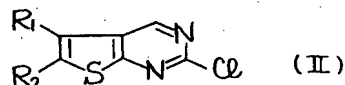
(I)

〔式中 R₁、R₂はそれぞれ水素、アルキル、ハロゲンもしくは一筋になってアルキレン鎖又は異種原子を含むアルキレン鎖を意味する。〕で示される2-クロロ-3,4-ジヒドロチエノ [2,3-d] ピリミジン類化合物の新規の製造法に関するものである。

本発明の式(I)の化合物は特開昭55-

27105号公報に記載されているように極めて強い血小板凝集抑制作用を有する化合物の中間体として有用である。

本発明は式



(II)

〔式中 R₁、R₂は前記と同じ。〕で示される新規化合物を水素化ホウ素アルカリ金属類と処理することにより式(I)の化合物を製造する方法に関する。

(II)

反応は式(II)の化合物を水、メタノール、エタノールもしくはこれらとクロロホルム、テトラヒドロフランその他の不活性溶媒の混合物中水

素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム等と室温乃至60℃前後まで1時間乃至20時間前後反応させると式(I)の化合物がえられる。

次に具体例をもって説明するが、本発明はここに記載した反応条件に限定されるものではない。

実施例 1

2-クロル-5,6,7,8-テトラヒドロ(1)ベンゾチエノ〔2,8-d〕ピリミジン2.25gをクロロホルム-エタノール(1:1)の混合溶媒中、水素化ホウ素ナトリウム2.00gを室温で少献づつ加えたのち同温で8時間攪拌する。溶媒を留去し、残渣に水を加え不溶物を濾取し、よく水洗乾燥すると2-クロル-8,4,5,6,7,8-ヘキサヒドロ(1)ベンゾチエノ〔2,8-d〕ピリミジンが1.85g得られた。融点186~140℃。

IR_{max}^{KBr} cm⁻¹: 8140, 1580

NMR δ(CDCl₃): 4.68 (2H, s, CH₂)

元素分析 C₁₇H₁₇ClN₂O₂Sとして

計算値 C 61.84, H 5.15, N 8.42

分析値 C 61.24, H 5.82, N 8.40

実施例 2~7

以下実施例1に準じて次の反応を実施した。結果は一括表示する。反応溶媒はいずれもエタノールとクロロホルムの混合溶媒を用いた。NMRは4-位メチレンプロトンのケミカルシフトを示した。いずれも singlet signal を示す。

例	R ₁	R ₂	温度 (℃)	時間	融点 (℃)	IR (cm ⁻¹)	NMR (s)
2	H	H	25	1	146-148	8150 1590	4.80
3	CH ₃	H	25	1	162-165	8150 1580	4.65
4	CH ₃	CH ₃	25	5	170-172	8150 1580	4.54
5	Cl	CH ₃	25	1	172-174	8140 1585	4.67
6	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -		25	2	152-165	8150 1580	4.60
7	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ -		25	1	157-160	8150 1590	4.59

参考例：原料の製法

2,4-ジクロル-5,6,7,8-テトラヒドロ(1)ベンゾチエノ〔2,8-d〕ピリミジン5.2gをクロロホルム-エタノール(1:1)の混合溶媒中、水素化ホウ素ナトリウム4.56gを加え浴温40~50℃の水浴中14時間攪拌する。溶媒を留去後、残渣に水を加え不溶分を濾取し水洗、乾燥する。これをベンゼン200ml中クロル^ニア^ニール5.40gと80分加熱攪拌する。冷后、0.5N-水酸化ナトリウム液で洗い、水洗后ベンゼンを留去すると融点101~108℃の2-クロル-5,6,7,8-テトラヒドロ(1)ベンゾチエノ〔2,8-d〕ピリミジン3.66gが得られる。